

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平6-65023

(43) 公開日 平成6年(1994)3月8日

(51) Int. Cl. ⁵	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A 6 1 K	7/00	C 9104-4C W 9104-4C		
	7/06	8615-4C		
	7/075	8615-4C		
	7/16	7252-4C		

審査請求 未請求 請求項の数2 (全 7 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願平4-237768	(71) 出願人	000160522 久光製薬株式会社 佐賀県鳥栖市田代大宮町408番地
(22) 出願日	平成4年(1992)8月12日	(72) 発明者	中川 晃 佐賀県鳥栖市田代大宮町408番地 久光製 薬株式会社内
		(72) 発明者	平野 宗彦 佐賀県鳥栖市田代大宮町408番地 久光製 薬株式会社内
		(72) 発明者	小田 英志 佐賀県鳥栖市田代大宮町408番地 久光製 薬株式会社内

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 (一) イソブプレゴールからなる冷感剤及び冷感性組成

物

(57) 【要約】 (修正有)

【目的】 ①揮散性を示さない、②刺激臭が極めて少ない、③十分な冷却作用を有する、④基剤中で結晶化しない、⑤原料コストが安価、⑥各種基剤と相溶性が良い等のすぐれた特徴を有する冷感剤及び冷感性組成物の提供。

【構成】 構造式(1)の(一)イソブプレゴールからなる冷感剤及び冷感性組成物に関し、外皮適用を目的とした化粧品及び医薬品、あるいは口腔内適用の製剤からなる。



【効果】 構造式(1)の(一)イソブプレゴールはL-メントールに比べて匂いが極めて少なく、口腔内のみならず皮膚を対象とした場合でも十分な冷感効果を発揮する。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 化学構造式(1)

【化1】



(1)

で表わされる(一)イソプロレゴールからなる冷感剤

【請求項2】 請求項1記載の(一)イソプロレゴールからなる冷感性組成物

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】本発明は、(一)イソプロレゴールからなる冷感剤及び冷感性組成物に関する。

【0002】

【従来の技術】従来より、皮膚や口の粘膜に対して生理的に冷たい感じを与える、いわゆる冷涼作用を有する化合物として、ハッカ油及びハッカ油の主成分であるローメントールが知られており、これは芳香剤として食品、飲料、歯磨、タバコ等に配合されている。また冷感剤として各種の化粧品、外用剤などに広汎に使用されている。しかしながら、ローメントールは冷涼効果としては強いものの、特異なハッカ臭を有すると共に昇華性のため、冷涼効果の持続性については充分なものとはいえない。特に特異なハッカ臭の香りについては、化粧品等の各種製剤に配合処方する場合、化粧品特有の優雅な芳香性を損なう等して処方上問題があった。また昇華性のため冷涼効果の持続性を特に要求されるシップ剤やデブ

リ剤等の医薬貼付剤として処方するうえでも充分でなかった。

【0003】しかも、これらの貼付剤として処方する場合、固体であるローメントールは、他の薬剤及び基剤と充分に混合溶解された状態で配合処方されるが、処方されたものは基剤中でしだいに結晶化し、有効成分である薬物の放出性の低下及び冷涼効果の低下、さらには基剤の安定性等に問題が生じるため、ローメントールの溶解剤として他の成分の添加の必要性が生じる。またローメントールは原料として非常に高価であるので製品コストを考慮すると大きな負担であった。

【0004】近年匂いの軽減化を圖つたローメントール誘導体及び経絡化合物に関する特許が多数見受けられるようになった。例えば、特開昭47-16647号公報、同47-16649号公報、同58-88334号公報、同61-194049号公報、特開平2-290827号公報等にはメントール誘導体に関するもの、特開昭58-93454号公報、同58-95194号公報には三環式アルコール類、特開昭60-136544号公報には三環式アミド類等の冷感剤が開示されてい

る。

【0005】

【発明が解決しようとする課題】前述したローメントールやメントール類縁化合物を化粧品や医薬品の成分として製剤処方する場合、①冷涼効果、②冷涼作用の持続性、③特異臭(ハッカ臭)、④製剤における安定性、⑤経済性(製品コスト)、⑥溶解性、⑦昇華性等のいずれかの問題を生じるため、充分満足する製品を提供できない。

【0006】特に、昇華性であるローメントールの特異なハッカ臭はわずかな量で広範囲まで及び目や鼻粘膜に刺激を与える、そのためローメントールを取り扱う製造工程の作業環境としては好ましくない状況ではない。また製品として使用するうえでもハッカ臭の香りを気にする傾向にあり、使用上問題があった。また昇華性であるため、使用中の品質の安定性を維持することは困難を要するものであった。

【0007】そこで、本発明は口腔内又は皮膚を対象とした化粧品、口腔製剤及び医薬品等の、各種製剤を開発するうえで、①常温で昇華しない、②特異臭がより少ない、③充分な冷涼効果を有する、④基剤中で結晶化しない、⑤原料コストが安価、⑥各種基剤と相溶性が良い等の優れた特徴を有する冷感剤及び冷感性組成物の開発を目的とするものである。

【0008】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、上記問題を解決すべく鋭意研究を重ねた結果、ローメントールの化学構造に類似する下記化学構造式(1)で表される(一)イソプロレゴール(化学名：(一)2-イソプロベニル-5-メチルシクロヘキサノール)に着目し、冷感作用等について検討したところ、意外にもローメントールに匹敵する冷感作用を有し、口腔内のみならず皮膚を対象とした場合でも充分な冷感作用を有することが判明した。

【0009】

【化2】



(1)

又、ローメントール及びハッカ油に比べハッカ特有の香りが少なく、しかも昇華性のない安定性の高い化合物であることが判明した。

【0010】又、本化合物は常温で液体であるため、製剤処方時に溶解剤等の添加物を用いる必要もなく、さらに各種基剤との相溶性に優れているため配合処方するうえで大変好ましい状態をもたらすものである。

【0011】尚、本化合物の(一)イソプロレゴールは

モンガラ等の精油中に存在し、従来よりローズ、ゼラニウム、オリエンタル調の調合香料、セッケンや食品等の香料として、あるいはシメンツールの合成中間体として広く利用されているものであるが、冷感作用を有することは全く知られておらず、ましては冷感作用を目的とした冷感性組成物に関しては全く検討されていない。

【0012】また先行技術文献等においても冷感作用並びにそれらを示唆する記載は存在せず、本化合物である(一)イソプレゴールの冷感作用及び冷感性組成物については本発明者らが鋭意研究した結果初めて見出したものである。

【0013】新規な冷感剤として見出された(一)イソプレゴールは医薬品、医薬部外品又は食品等への応用が考えられ、これらへの処方については公知の基剤又は薬剤との併用により適宜行なうことができる。

【0014】また、上記処方においては(一)イソプレゴールの冷却作用を損なわない限りにおいて、他の成分、例えば防腐剤、抗酸化剤、香料、着色料、界面活性剤等を添加配合することができる。

実施例1 ローション

	(重量%)
エタノール	59.0
精製水	35.0
プロピレングリコール	5.0
(一)イソプレゴール	1.0

上記組成の冷感剤を調製した。このものを皮膚に適用するとさわやかなメントール様の冷感感を与えた。

実施例2 ヘアトニック

	(重量%)
エタノール	52.0
ホホバ油	0.4
ポリオキシエチレンソルビタン	1.2
ラウレート	
プロピレングリコール	1.2
トリクロラン	0.1
色素	微量
(一)イソプレゴール	0.5
精製水	残量

上記配合物を混合し均一として、ヘアトニックを調製した。このヘアトニックを頭皮につけると、エタノールの蒸発による冷却効果が終わった後も爽やかな冷感感が

実施例3 スキンローション

	(重量%)
エタノール	20.0
プロピレングリコール	5.0
グリセリン	4.5
パラオキシ安息香酸メチル	0.1
香料	0.2
精製水	70.0
(一)イソプレゴール	0.2

【0015】すなわち、本発明の冷感剤は、軟膏、クリーム、ゲル、ローション、エアゾール剤、成形バップ剤、テープ剤、内服剤等の医薬品、パウダー、ヘアトニック、シャンプー、口紅等の化粧品、歯磨き等の口内洗浄剤、チュウインガム、キャンデー、冷菓、清涼飲料等の食品等に配合して冷却効果を付与した冷感性組成物として使用される。

【0016】本冷感剤の添加量は特に制限はないが、使用量としては0.01~5重量%の範囲で用いるのが好ましい。

【0017】尚、医薬品及び化粧品の種類において薬効成分として公知の薬剤を適宜配合処方することができる。

【0018】

【実施例】以下に実施例を挙げて本発明を詳細に説明するが、本発明はこれら実施例に限定されるものではない。

【0019】

【0020】

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

※

冷涼効果 サンプル	舌 先	前胸内側の皮膚
(-)イソプレゴール	+++	++
Ｌ-メントール	+++	++

以上の結果から明かなごとく、(-)イソプレゴールは * 3時間以上 _____ 3
 Ｌ-メントール同様、舌先のみならず皮膚においても 10 3時間以下 _____ 2
 十分な冷感を有していた。 1時間以下 _____ 1

【0032】試験例2
 健康成人男子26名に対して、実施例8および比較例1 5分以内 _____ 3
 で得られたバップ剤を前胸表側に貼付し、その生理学的冷涼効果と匂いを比較検討した。下記の各項目につき 5～10分以内 _____ 2
 試験し判定した。結果を表2に示す。 10分以上 _____ 1

【0033】なお、判定方法は各試験項目において該当 二) 匂いの強さ _____ 3
 する試験結果を下記の点数で被験者より報告させる方法 匂いが強い _____ 2
 をとった。 匂いが弱い _____ 1
 匂いがない

【0034】※試験項目、試験結果の配分及びその点数 20 【0035】以上4項目に関して、各被験者の回答した
 イ) 冷感の強さ 点数を各々合計し、各項目にわたって26人各平均値を
 冷感が強いもの _____ 3
 冷感がとばしいもの _____ 2
 冷感がないもの _____ 1

【0036】
 [表2]
 *

試験項目 試料名	冷感の 強さ	冷感の 持続	冷感の 速効性	匂いの 強さ
実施例8 のバップ剤	2.9	3.0	2.8	1.1
比較例1 のバップ剤	2.9	2.7	2.5	2.9

以上の結果から明らかなごとく、(-)イソプレゴールは
 Ｌ-メントールに匹敵する冷感を有し、匂いもマイ
 ルドであった。

【0037】試験例2

実施例8及び比較例2のバップ剤を5℃で保存し結晶化
 の経時変化を観察した。結果を表3に示す。

【0038】

[表3]

11

12

経時 試料名	初期	1日	3日	7日	14日
実施例8 のバップ剤	○	○ ○	○ ○	○ ○	○ ○
比較例2 のバップ剤	○	○ ×	× ×	× ×	× ×

○：結晶化を認めない

×：結晶化を認める

【0039】以上の結果から明かなごとく溶解剤を添加しない比較例2ではL-メントールが経時的に結晶化してしまうのに対し、(一)イソプレゴールでは単独で基剤中に溶解して存在した。

【0040】

【発明の効果】本発明の(一)イソプレゴールからなる冷感剤及び冷感性組成物は、口腔内のみならず皮膚においても十分な冷感作用を有し、L-メントールに比べて匂いも極めて少ないうえに、昇華性でないので経時的にて非常に安定で製剤上処方しやすい。しかも常温で液

体であるため溶解剤を必要としない。又、製剤的にも安定性の高い製品の開発が可能で作業環境にも問題を生じないという特徴を有するものである。すなわち、本発明の冷感剤は、軟膏、クリーム、ゲル、ローション、エアゾール剤、成形バップ剤、テープ剤、内服剤等の医薬品、パウダー、ヘアトニック、シャンプー、口紅等の化粧品、歯磨き等の口内洗浄剤、チュウインガム、キャンデー、冷凍、清涼飲料等の食品等に配合してさわやかな冷感効果を付与した冷感性組成物として使用され、極めて有用である。

フロントページの続き

(51) Int. Cl.⁵

識別記号

庁内整理番号

F I

技術表示箇所

A 61 K 7/48

9051-4C

// A 23 G 3/30

A 23 L 2/00

A

C 07 C 13/19

9280-4H

35/17

8827-4H

C 11 B 9/00

D 2115-4H

(72)発明者 鶴田 清美

佐賀県鳥栖市田代大宮町408番地 久光製薬株式会社内

(72)発明者 益田 憲治

佐賀県鳥栖市田代大宮町408番地 久光製薬株式会社内

(72)発明者 浦田 良明

佐賀県鳥栖市田代大宮町408番地 久光製薬株式会社内